



PATENT COOPERATION TREATY

PCT Rec'd PCT/PTO 23 MAR 2005

Translation

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference NO5-IKEDA	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2003/014610	International filing date (day/month/year) 17 November 2003 (17.11.2003)	Priority date (day/month/year) 19 November 2002 (19.11.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07C 271/20, 271/22, 269/06, A61K 48/00, 31/198, A61P 43/00, C07K 1/08, 5/027, 5/033		
Applicant IKEDA, Hisafumi		

1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 3 sheets, including this cover sheet.
3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
  - a. ☒ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of 12 sheets, as follows:
    - ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
    - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
  - b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) \_\_\_\_\_, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).
4. This report contains indications relating to the following items:
  - ☒ Box No. I Basis of the report
  - ☐ Box No. II Priority
  - ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
  - ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
  - ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
  - ☐ Box No. VI Certain documents cited
  - ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
  - ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 14 June 2004 (14.06.2004)	Date of completion of this report 14 February 2005 (14.02.2005)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/014610

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

- ☐ This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:
- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
  - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
  - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

- ☐ The international application as originally filed/furnished
- ☒ the description:
- pages \_\_\_\_\_ 1-10, 16-30, 33-44 \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_ 11-15, 31-32 \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_ 14 June 2004 (14.06.2004)
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☒ the claims:
- pages \_\_\_\_\_ 10-12 \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19
- pages\* \_\_\_\_\_ 1, 6-9 \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_ 14 June 2004 (14.06.2004)
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☒ the drawings:
- pages \_\_\_\_\_ 1/1 \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☒ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☒ the claims, Nos. \_\_\_\_\_ 2-5 \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

**Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**

**1. Statement**

Novelty (N)

Claims

1, 6-12

YES

Claims

NO

Inventive step (IS)

Claims

1, 6-12

YES

Claims

NO

Industrial applicability (IA)

Claims

1, 6-12

YES

Claims

NO

**2. Citations and explanations (Rule 70.7)**

Document 1: WO, 02-85413, A1 (Artzyme Biotech Corp.), 31 October, 2002 (31.10.02), & EP, 1381392, A1, & US, 2002-165365, A1

Document 2: WO, 02-51797, A1 (Hisafumi Ikeda), 4 July, 2002 (04.07.02), & EP, 1357112, A1

The subject matters of claims 1 and 6-12 appear to be novel and to involve an inventive step in view of documents 1 and 2 cited in the ISR.

The subject matters of claims 1 and 6-12 are neither described in documents 1 and 2 nor could have been easily arrived at from the descriptions of documents 1 and 2.

REC'D 03 MAR 2005

WIPO

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)  
[PCT 36条及びPCT規則70]

Rec'd PCT/PTO 23 MAR 2005

出願人又は代理人 の書類記号 NO5-IKEDA	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/14610	国際出願日 (日.月.年) 17. 11. 2003	優先日 (日.月.年) 19. 11. 2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl. C07C271/20, 271/22, 269/06, A61K48/00, A61K31/198, A61P43/00, C07K1/08, 5/027, 5/033		
出願人 (氏名又は名称) 池田 壽文		

1. この報告書は、PCT 35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第57条 (PCT 36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 3 ページからなる。
3. この報告には次の附属物件も添付されている。
- a ☒ 附属書類は全部で 12 ページである。
- ☒ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT 規則70.16及び実施細則第607号参照)
- ☐ 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
- b ☐ 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。  
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☐ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- ☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT 35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☐ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☐ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 14. 06. 2004	国際予備審査報告を作成した日 14. 02. 2005	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JIP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 前田 憲彦	4H 8318
電話番号 03-3581-1101 内線 3443		

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、\_\_\_\_\_語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査

☐ PCT規則12.4にいう国際公開

☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に回答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☐ 出願時の国際出願書類

☒ 明細書

第 1-10, 16-30, 33-44 ページ、出願時に提出されたもの

第 11-15, 31-32 ページ\*、14.06.2004 付けて国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ\*、\_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☒ 請求の範囲

第 10-12 項、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第 1, 6-9 項\*、14.06.2004 付けて国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、\_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☒ 図面

第 1/1 ページ/図、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、\_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、\_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☒ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ

☒ 請求の範囲 第 2-5 項

☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること)

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ

☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項

☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること)

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)	請求の範囲	1, 6-12	有 無
	請求の範囲		
進歩性(IS)	請求の範囲	1, 6-12	有 無
	請求の範囲		
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲	1, 6-12	有 無
	請求の範囲		

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1. WO 02/85413 A1(Artzyme Biotech Corporation)2002.10.31  
& EP 1381392 A1 & US 2002/165365 A1  
文献2. WO 02/51797 A1(IKEDA, Hisafumi)2002.07.04  
& EP 1357112 A1

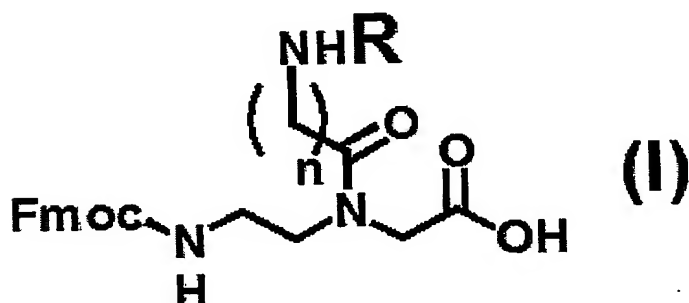
請求の範囲1, 6-12の発明は、国際調査報告で示された文献1-2に対して新規性及び進歩性を有する。  
請求の範囲1, 6-12の発明は、文献1-2に記載されておらず、かつ、文献1-2の記載から容易になし得るものでもない。

発明の開示

上記課題に鑑み研究を重ねた結果、本発明者らは、多岐にわたる新規な前駆体的 Fmoc 型 PNA モノマーユニットおよびその製造方法を用いることによって、驚くべきことに、従来法における前記課題が克服され、かつ極めて広範にわたる機能性 PNA モノマーユニットおよび機能性 PNA オリゴマーを合成できることを見出し、本発明を完成するに至った。

すなわち、本発明は、下記一般式 (I) :

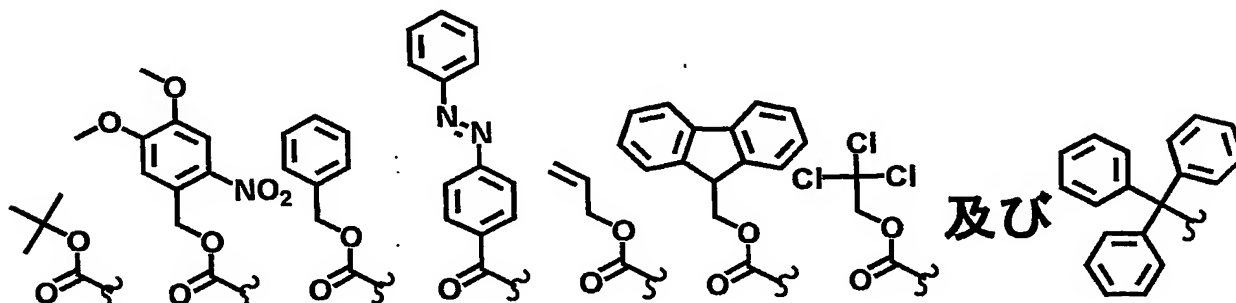
【化 2 3】



(式中、R は下記の機能性分子の群から選択され、n は 1 ~ 11 までの整数を表す。)

によって表される化合物に関する。

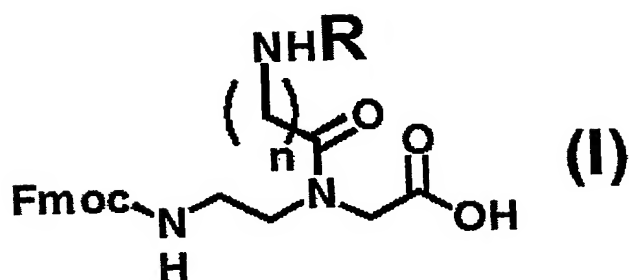
【化 2 4】



12

また、本発明は、下記一般式 (I) :

【化 2 5】

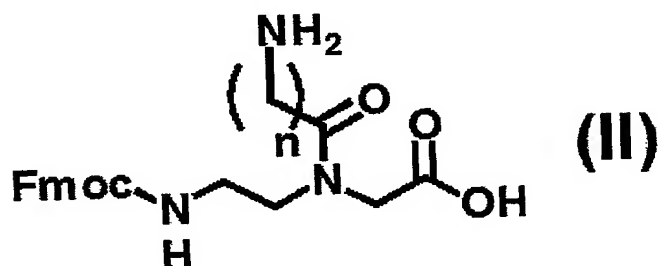


(式中、R は機能性分子または保護基を表し、n は 1 ~ 11 までの整数を表す。

) で表される化合物を製造するための方法であって、下記工程 a) ~ b) の 1 つを含む、前記方法に関する :

a) 下記一般式 (I I)

【化 2 6】



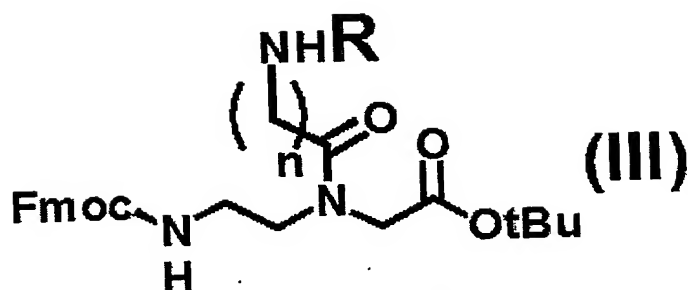
(式中、n は 1 ~ 11 までの整数を表す。) で表される化合物を、機能性分子の O S u または O P f p との活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

b) 下記一般式 (I I I)



13

【化 27】

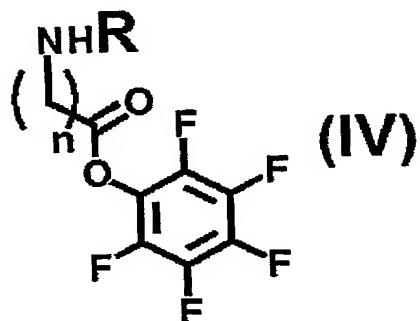


(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1～11までの整数を表す。

)で表される化合物を、加水分解する工程、および

c) 下記一般式 (IV)

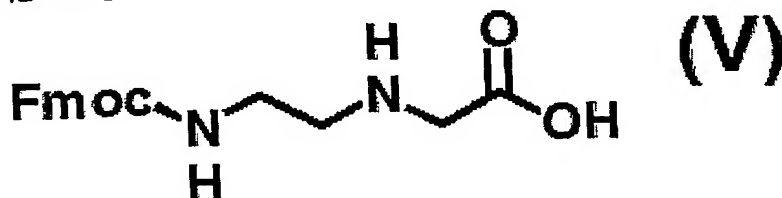
【化 28】



(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1～11までの整数を表す。

)で表される化合物を、下記一般式 (V)

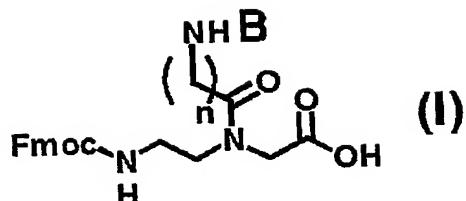
【化 29】



で表される化合物と反応せしめる工程。

さらに、本発明は、機能性 PNA オリゴマーを製造するための方法であつて、下記一般式 (I)

## 【化30】

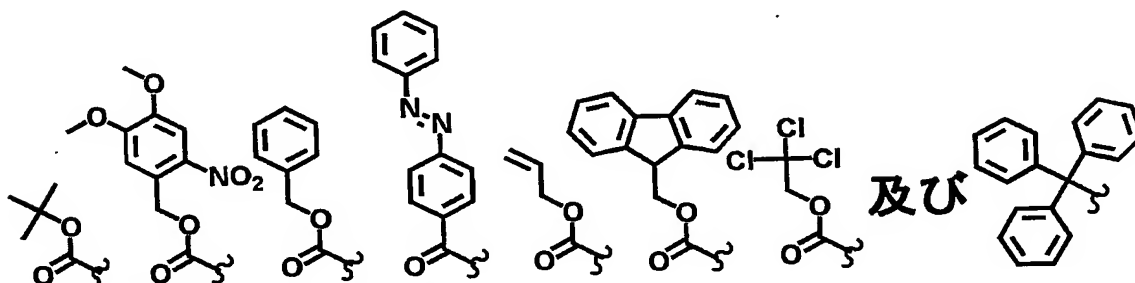


(式中、BはH、機能性分子または保護基を表し、nは1～11までの整数を表す。)

で表される化合物の1種または2種以上を結合したPNAオリゴマーにおいてBのうち、H、または保護基の一部またはすべてについて順次または同時に機能性分子によって置換する工程を含む、前記方法に関する。

またさらに、本発明は、Rが、

## 【化31】

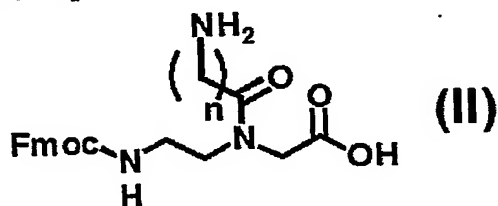


からなる群から選択される、前記方法に関する。

さらにまた、本発明は、一般式(I)で表される化合物が、下記a)～c)の工程の1つによって製造される、前記方法に関する：

a) 下記一般式(III)

## 【化32】

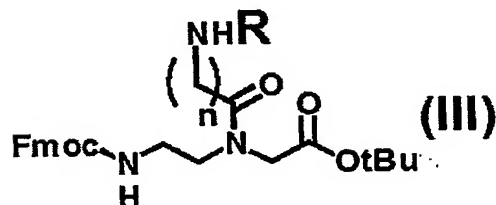


(式中、nは1～11までの整数を表す。)で表される化合物を、機能性分子の

OSuまたはOPfpとの活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

b) 下記一般式 (III)

【化33】

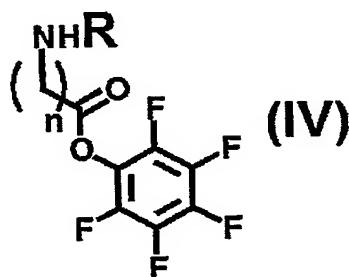


(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1～11までの整数を表す。)

) で表される化合物を、加水分解する工程、および

c) 下記一般式 (IV)

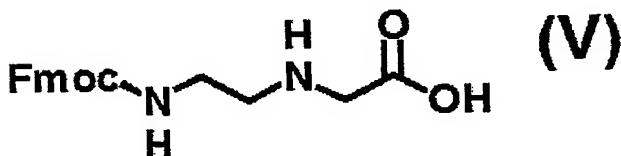
【化34】



(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1～11までの整数を表す。)

) で表される化合物を、下記一般式 (V)

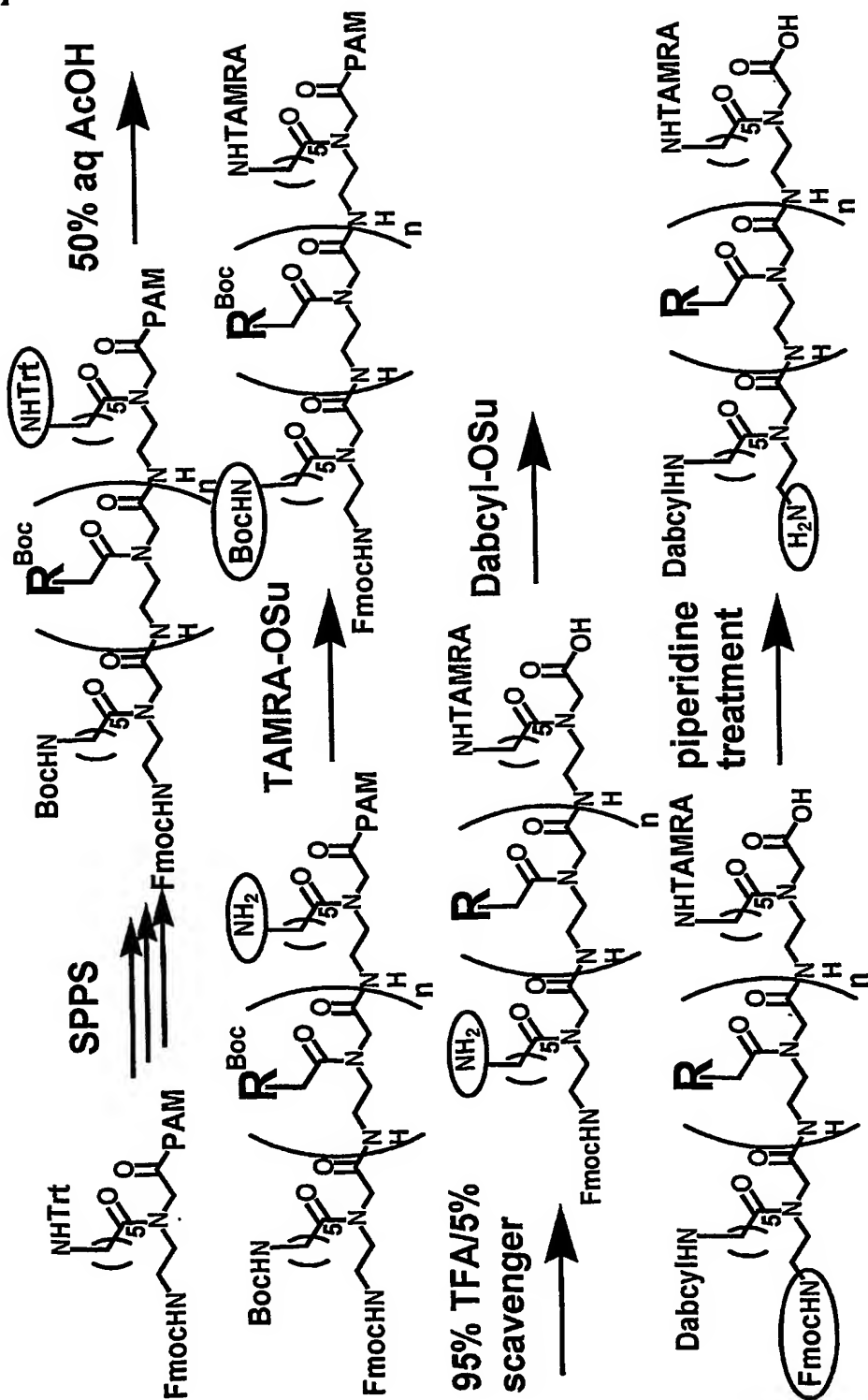
【化35】

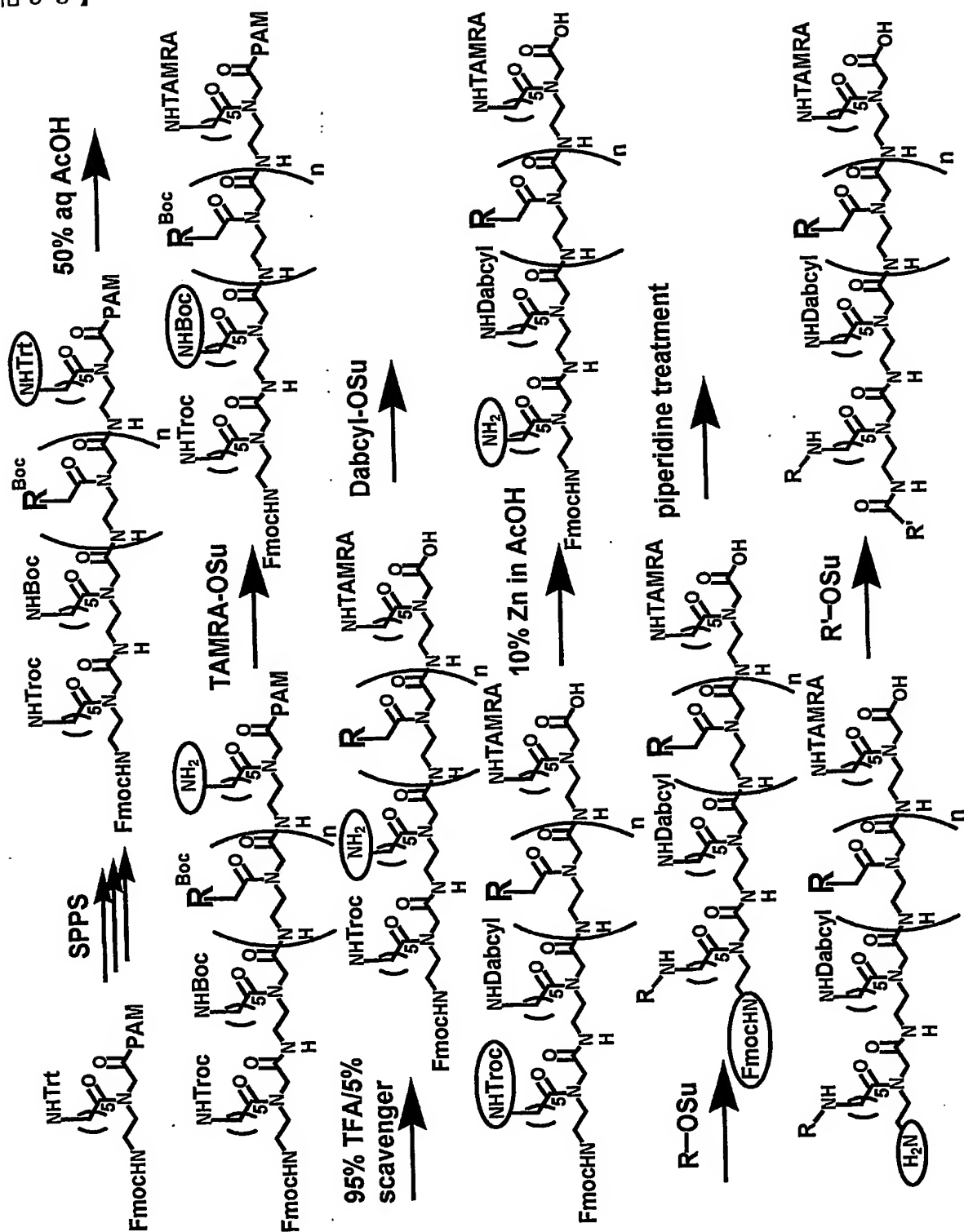


で表される化合物と反応せしめる工程。

また、本発明は、機能性分子が、光放出性分子、光消失性分子、膜透過機能性分子、臓器選択性機能性分子、殺菌性機能性分子、分子認識性機能性分子、光架

【化 5 2】

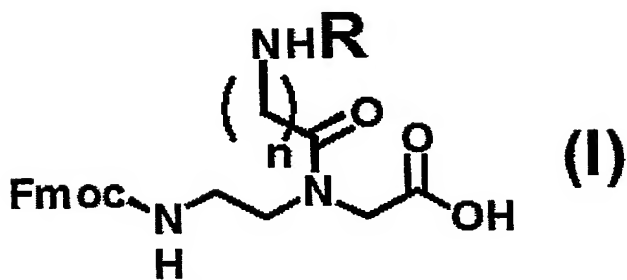




請 求 の 範 囲

1. (補正後) 下記一般式 (I) :

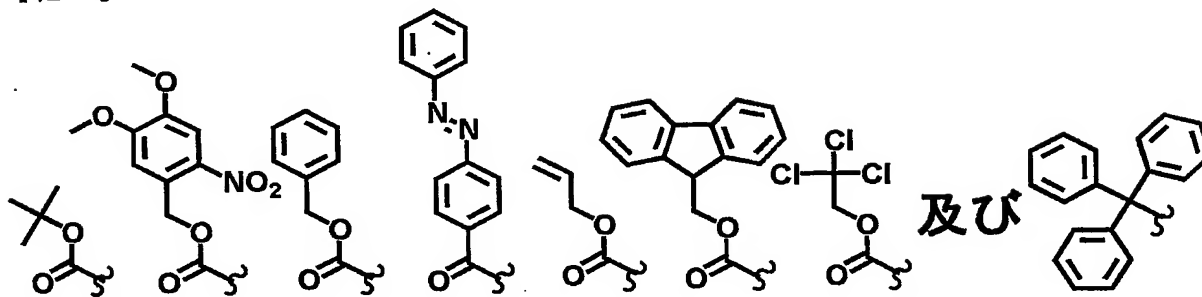
【化 1】



(式中、R は下記の機能性分子の群から選択され、n は 1 ～ 11 までの整数を表す。)

によって表される化合物。

【化 2】



2. (削除)

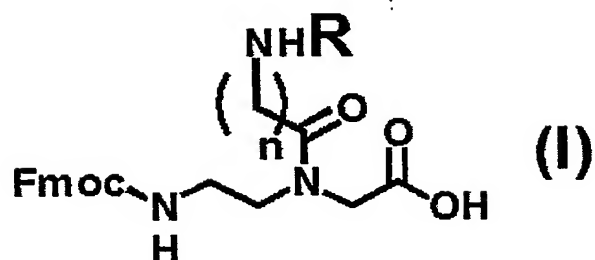
3. (削除)

4. (削除)

5. (削除)

6. (補正後) 下記一般式 (I) :

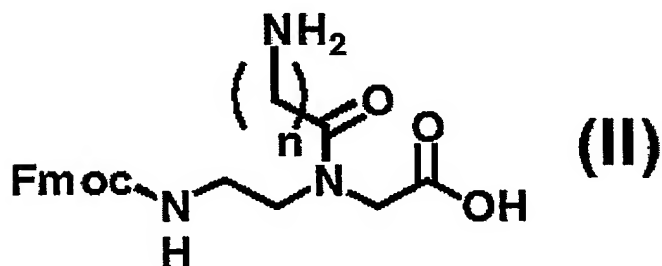
【化3】



(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1～11までの整数を表す。  
 )で表される化合物を製造するための方法であって、下記工程a)～c)の1つを含む、前記方法:

a) 下記一般式 (II)

【化4】

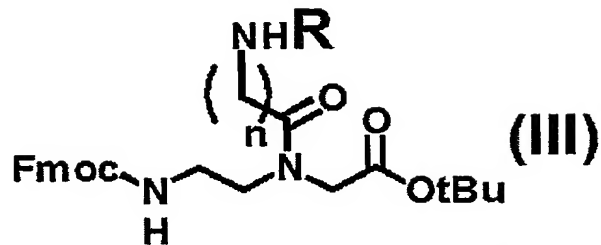


(式中、nは1～11までの整数を表す。)で表される化合物を、機能性分子のOSuまたはOPfpとの活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

47

b) 下記一般式 (III)

【化5】

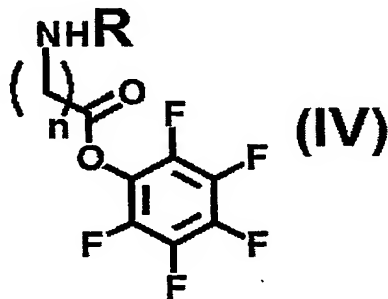


(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1～11までの整数を表す。)

) で表される化合物を、加水分解する工程、および

c) 下記一般式 (IV)

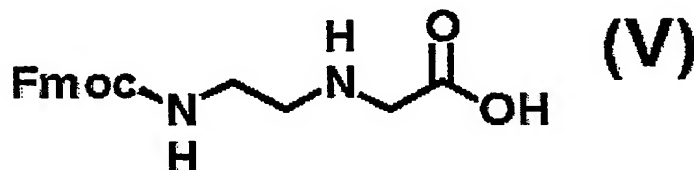
【化6】



(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1～11までの整数を表す。)

) で表される化合物を、下記一般式 (V)

【化7】



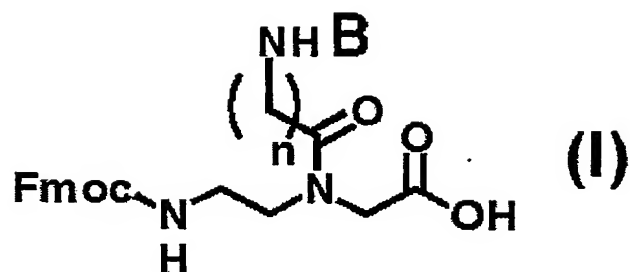
で表される化合物と反応せしめる工程。

7. (補正後)

機能性PNAオリゴマーを製造するための方法であって、下記一般式 (I)



【化8】

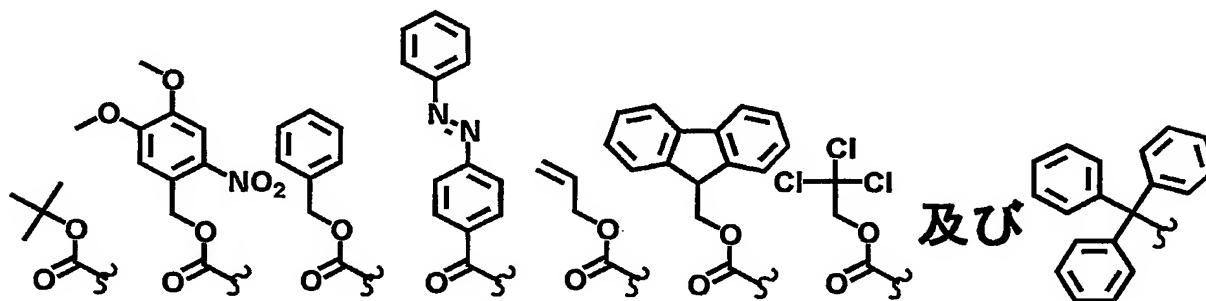


(式中、BはH、機能性分子または保護基を表し、nは1～11までの整数を表す。)

で表される化合物の1種または2種以上を結合したPNAオリゴマーにおいてBのうち、H、または保護基の一部またはすべてについて順次または同時に機能性分子によって置換する工程を含む、前記方法。

8. (補正後) Bにおける機能性分子が、

【化9】

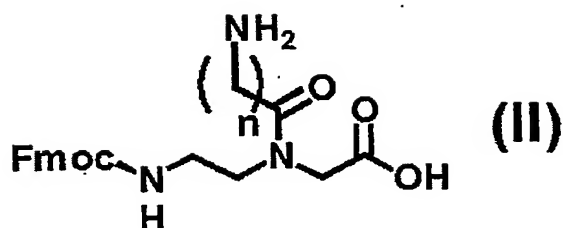


からなる群から選択される、前記請求の範囲第10項に記載の方法。

9. (補正後) 一般式(I)で表される化合物が、下記a)～c)の工程の1つによって製造される、前記請求の範囲第6項または第7項に記載の方法:

a) 下記一般式(II)

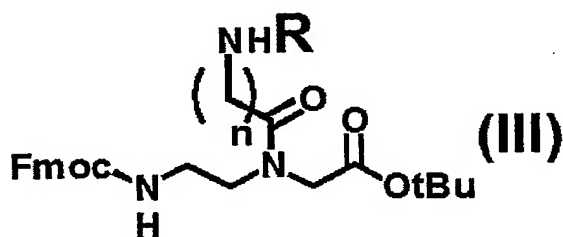
【化10】



(式中、 $n$  は1～11までの整数を表す。) で表される化合物を、機能性分子の O S u または O P f p との活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

b) 下記一般式 (III)

【化11】

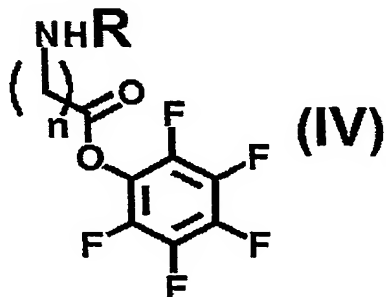


(式中、 $R$  は機能性分子または保護基を表し、 $n$  は1～11までの整数を表す。

) で表される化合物を、加水分解する工程、および

c) 下記一般式 (IV)

【化12】



(式中、 $R$  は機能性分子または保護基を表し、 $n$  は1～11までの整数を表す。

) で表される化合物を、下記一般式 (V)